

特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

REC'D 06 OCT 2005

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 KOTO-19/PCT	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/008678	国際出願日 (日.月.年) 15.06.2004	優先日 (日.月.年) 27.06.2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. ⁷ A61K31/397, 31/216, 31/40, 45/00, A61P3/06, 9/10, 43/00 // C07D405/10, 405/12		
出願人 (氏名又は名称) 特 製 薬 株 式 会 社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 5 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a. ☐ 附属書類は全部で ページである。

☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)

☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b. ☐ 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 21.12.2004	国際予備審査報告を作成した日 22.09.2005		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 荒 木 英 則	4C	9736
	電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
☐ PCT規則12.4にいう国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第_____ ページ、出願時に提出されたもの
 第_____ ページ*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第_____ ページ*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第_____ 項、出願時に提出されたもの
 第_____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第_____ 項*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第_____ 項*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第_____ ページ/図、出願時に提出されたもの
 第_____ ページ/図*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
 第_____ ページ/図*、_____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第_____ ページ
☐ 請求の範囲 第_____ 項
☐ 図面 第_____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第_____ ページ
☐ 請求の範囲 第_____ 項
☐ 図面 第_____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

次に、次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- 請求の範囲 8

この国際出願又は請求の範囲 8 は、国際予備審査をすることを要しない
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 8 に係る発明は治療による人体の処置方法に関するものであり、国際予備審査をすることを要しないものに相当する。
(PCT 34 条(4)(a)(i)、PCT 規則 67.1(iv))

- 「明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 _____ の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

- 「全部の請求の範囲又は請求の範囲_____が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

- 2 請求の範囲 8 について、国際調査報告が作成されていない。

- 「ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

提出されていない。
 所定の基準を満たしていない。
 提出されていない。
 所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

- 「コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

- 「提出されていない。
- 「所定の技術的な要件を満たしていない。

- 「 詳細については補充欄を参照すること。」

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-7	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲		有
	請求の範囲	1-7	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-7	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

見解は、国際調査報告で引用された以下の文献1-3、および、本見解において新たに引用する文献4、5の記載に基づいて示される。

文献1: WO 02/058732 A2 (SCHERING CORPORATION)

文献2: JP 8-505141 A (シェリング・コーポレーション)

文献3: WO 02/066464 A1 (寿製薬株式会社)

文献4: HEEK, M., *et al.*, Br. J. Pharmacol., 2000, 129, pp.1748-1754

文献5: ZETIA: Prescribing Information. [online]. MERCK/Schering-Plough Pharmaceuticals, 2001, 2002. [retrieved on 2005-05-09] Retrieved from the Internet: <URL: http://www.drugs.com/PDR/Zetia_Tablets.html (Zetia Tablets Professional Drug Information, 2003年3月発行のREV 01), http://www.zetia.com/zetia/shared/documents/zetia_pi.pdf (2005年3月発行のREV 07)>

○請求の範囲1-7について

文献1の請求の範囲及び実施例、並びに、文献2の請求の範囲及び実施例では、コレステロール低下剤としてのβ-ラクタム系化合物と、フィブレート系化合物又はコレステロール生合成阻害剤とを組み合わせることで有効成分とすることにより、血清コレステロール低下又はアテローム性動脈硬化症治療若しくは予防の作用が増強されたことが記載されている。ここで、請求の範囲1-7に係る発明と文献1及び2に記載されたものとを比較すると、前者は具体的な化合物の点で後者に相違する。

しかしながら、コレステロール吸収阻害作用を有する化合物としてβ-ラクタム系化合物のあることは文献1から3にあるように当業者に広く知られている事項であって、具体的な化合物についても文献3にあるように公知のものであるから、これを文献1及び2に記載のものにかえて用いてみることに、当業者が格別の創意を要したものとはいえない。

(続葉に続く。)

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

ところで、これに関し、出願人が 21. 12. 2004 付で提出した答弁書では、

(i) 文献 3 に記載の β -ラクタム系化合物は腸管に吸収されず、小腸においてコレステロール吸収を直接阻害するが、文献 1 および 2 に記載のものは、腸管で吸収および代謝を受けて活性本体となって血中に移行し、これが胆汁中を介して消化管に分泌されてコレステロール吸収を阻害するものであることが文献 3 および 4 にも記載されるように公知の事項であるから、両者の生体内挙動が異なり、他の薬剤と組み合わせた時の体内薬物動態も異なると考えるのが普通である旨、および、

(ii) 本願明細書の実施例では薬剤の併用により相乗効果が発揮されることが記載されており、一方、文献 2 では β -ラクタム系化合物とロバスタチンとを併用したことにより相乗効果を示すことが記載されているものの、文献 5 ではかかる効果は薬物動態学的な相互作用によるものと考えられ、副作用の発現や増大にも繋がるものであることが示唆されており、かつ、文献 1 に記載の化合物は文献 2 に記載の化合物と化学構造が酷似しており、文献 2 のものと同様の作用効果を示すものと考えられるため、文献 3 に記載の化合物を用いた本願発明は文献 1 および 2 に記載のものよりも優れた性能を有する旨、

を主張している。

しかしながら、体内での吸収および代謝を経て薬効を発現する薬剤では薬効発現の程度が体内動態を含めた生体内環境により大きく左右されることが当業者に広く知られたものであるから、そのような薬剤にかえて、吸収や代謝を要することなく同様の薬効を示す薬剤を用いてみようとするのは当業者が通常なし得る事項であり、文献 1 および 2 に記載の小腸におけるコレステロール吸収の阻害という薬効を示す化合物に変えて文献 3 に記載のものにしてみることも同様である。

また、相乗効果の点については、本願明細書で記載されたものと文献 1 から 3 で示されたものとはその試験方法が異なるため、本願発明が文献 1 から 3 に記載されたものと比べて格別優れた作用を示すものであるとは認められず、副作用の点についても、文献 3 および 4 では文献 1 および 2 に記載の化合物と文献 3 に記載のものとはその体内動態が異なることが記載されているのであるから、当業者が当然認識する程度の事項であると認められる。

したがって、上記答弁書における主張を採用することはできず、請求の範囲 1-7 に係る発明は、文献 1 から 5 の記載により進歩性を有さない。